Состав

действующее вещество: trifluoperazine;
1 мл раствора содержит трифлуоперазина гидрохлорида 2 мг;
вспомогательные вещества: натрия цитрат, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.
Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная или слегка желтоватая жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Антипсихотические средства. Пиперазиновые производные фенотиазина.
Код АТХ N05A B06.

Фармакодинамика

Трифтазин-Дарница – антипсихотическое средство (нейролептик), пиперазиновое производное фенотиазина. Обладает антипсихотическим, седативным, противорвотным, каталептическим, гипотензивным, гипотермическим и слабым холиноблокирующим действием, также направленным против икоты.
Антипсихотическое действие связано с блокадой D2-дофаминовых рецепторов мезолимбической и мезокортикальной систем, блокадой α-адренорецепторов в центральной нервной системе (ЦНС), повышением высвобождения гормонов гипоталамуса и гипофиза.
Седативное действие развивается вследствие блокады адренорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга.
Противорвотное действие связано с блокадой периферических и центральных D2-дофаминовых рецепторов, блокадой окончаний блуждающего нерва в желудочно-кишечном тракте.
Гипотермическое действие развивается за счет блокады дофаминовых рецепторов гипоталамуса.
Седативное действие и влияние на вегетативную нервную систему выражены слабее, чем у других производных фенотиазина, экстрапирамидное и противорвотное действие – сильнее.

Фармакокинетика

После внутримышечного введения обладает эффектом «первичного прохождения» через печень. Прочно связывается с белками плазмы крови, уровень связывания составляет 95 %. Время достижения максимальной концентрации (Tmax) в крови – 1–2 часа. Проникает через гематоэнцефалический барьер, в грудное молоко. Интенсивно метаболизируется в печени, продукты метаболизма фармакологически неактивны. Период полувыведения (T1/2) составляет 15–30 часов. Метаболиты выводятся из организма желчью и почками. Слабо диализируется в связи с высоким связыванием с белками плазмы крови.

Показания

Психотические расстройства, в том числе шизофрения.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к компонентам лекарственного средства, другим лекарственным средствам фенотиазинового ряда. Декомпенсированная сердечная недостаточность, выраженная артериальная гипотензия. Депрессия ЦНС. Кома любой этиологии. Прогрессирующие системные заболевания головного и спинного мозга. Стенокардия. Рак молочной железы.
Закрытоугольная глаукома. Функциональная почечная и печеночная недостаточность, повреждения печени. Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в период обострения. Эпилепсия, болезнь Паркинсона. Нарушение механизма центральной регуляции дыхания (особенно у детей), синдром Рейе. Кахексия. Феохромоцитома. Пролактинзависимая опухоль. Микседема. Гиперплазия предстательной железы. Патологические изменения крови, связанные с нарушением кроветворения. Период беременности или кормления грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Средства, угнетающие функции центральной нервной системы (средства для наркоза, опиоидные аналгетики, барбитураты, анксиолитики, этанол и этанолсодержащие препараты) – усиливается эффект лекарственного средства, усиливается депрессия ЦНС и угнетается дыхание.
Индукторы CYP1A2 (карбамазепин, фенобарбитал, рифампицин, аминоглютетимид) – снижают концентрацию и эффект Трифтазина-Дарница.
Ингибиторы CYP1A2 (амиодарон, ципрофлоксацин, флувоксамин, кетоконазол, норфлоксацин, офлоксацин, рофекоксиб) – повышают концентрацию и эффект

Трифтазина-Дарница.
α-адреноблокаторы – усиливают гипотензивные эффекты лекарственного средства.
Леводопа и фенамины – снижают эффект лекарственного средства.
Противоэпилептические средства – при одновременном применении снижается эффект противоэпилептических лекарственных средств.
Антитиреоидные препараты – увеличивается риск развития агранулоцитоза.
Астемизол, дизопирамид, эритромицин, прокаинамид – увеличивается риск развития тахикардии.
Трициклические антидепрессанты, мапротилин, ингибиторы МАО – возможны удлинение и усиление седативного и антихолинергического эффектов Трифтазина-Дарница.
Препараты лития – возможно усиление экстрапирамидных нарушений, ранние проявления признаков интоксикации литием.
Адреномиметики и симпатомиметики – одновременное применение может привести к парадоксальному снижению артериального давления.
Взаимно усиливаются эффекты при одновременном приеменении этанола.
Противосудорожные препараты – возможно снижение судорожного порога.
Лекарственные средства, вызывающие экстрапирамидные реакции (метоклопрамид) – возможно увеличение частоты и тяжести экстрапирамидных нарушений.
Антигипертензивные препараты – возможно развитие ортостатической артериальной гипотензии.
Прохлорперазин – возможна длительная потеря сознания.
Лекарственное средство может уменьшать сосудосуживающий эффект эфедрина и эпинефрина, усиливать антихолинергические эффекты других лекарственных средств, угнетать действие амфетаминов, леводопы, клонидина, гуанетидина.
Бромокриптин – фенотиазины угнетают способность бромокриптина снижать концентрацию пролактина в сыворотке крови.
Пропранолол, сульфадоксин – увеличивают концентрацию Трифтазина-Дарница в плазме крови.
Полипептидные антибиотики – одновременное применение может вызвать паралич дыхательных мышц.
Тразодон – наблюдается аддитивный гипотензивный эффект.
Вальпроиновая кислота – при одновременном применении наблюдается увеличение концентрации вальпроиновой кислоты в плазме крови.
Лекарственное средство может уменьшать эффект пероральных антикоагулянтов.
При одновременном применении с лекарственными средствами, которые удлиняют интервал QT (антиаритмические, неседативные антигистаминные, противомалярийные препараты, цизаприд, диуретики, трициклические

антидепрессанты), производные фенотиазина повышают риск развития желудочковых аритмий.
С осторожностью назначать одновременно с противотуберкулезными антибактериальными средствами.

Особенности применения

С осторожностью назначать лекарственное средство пациентам с глаукомой (противопоказано при закрытоугольной форме глаукомы), сердечно-сосудистыми заболеваниями, с нарушением функции печени, почек, цереброваскулярными, дыхательными нарушениями, желтухой, паркинсонизмом, сахарным диабетом, гипотиреозом, миастенией гравис, задержкой мочи, паралитической непроходимостью кишечника.

Пациенты, которые получают лекарственное средство в течение длительного периода, требуют внимательного наблюдения с целью своевременного выявления признаков поздней дискинезии, изменений со стороны глаз, системы крови, печени, нарушения сердечной проводимости.

При появлении признаков поздней дискинезии или злокачественного нейролептического синдрома прием лекарственного средства следует прекратить. Клинические проявления злокачественного нейролептического синдрома могут включать гиперексию, мышечную ригидность, изменения психического состояния и сознания, вегетативную нестабильность (иррегулярный пульс, изменения артериального давления, тахикардия, повышенное потоотделение, сердечная аритмия).

Особенно трудно диагностировать этот синдром у пациентов с тяжелыми заболеваниями (например с пневмонией, системной инфекцией и др.). Необходимо проводить дифференциальную диагностику у пациентов с патологией ЦНС, медикаментозной лихорадкой, тепловым ударом, центральной антихолинергической токсичностью. У некоторых пациентов, получавших комбинированную терапию с литием, наблюдался энцефалопатический синдром (слабость, вялость, лихорадка, дрожь, спутанность сознания, экстрапирамидные симптомы, лейкоцитоз, повышенный уровень ферментов, азота мочевины, глюкозы крови), в некоторых случаях развивались необратимые повреждения головного мозга, поэтому следует тщательно следить за ранними проявлениями неврологической токсичности и прекратить лечение сразу при появлении таких признаков.

Пациентам с синдромом Рейе, задержкой мочи, хроническими заболеваниями органов дыхания, рвотой лекарственное средство назначают только после

оценки соотношения пользы и риска лечения.

При лечении непсихотической тревожности трифлуоперазин большинству пациентов следует назначать после применения альтернативных лекарственных средств (например, бензодиазепинов), которые не имеют некоторых присущих трифлуоперазину побочных реакций.

Описан синдром отмены, который проявляется тошнотой, рвотой, потливостью, бессонницей. Также возможен рецидив психотических симптомов, появление двигательных расстройств (акатизия, дистония, дискинезия). Поэтому отмену лекарственного средства необходимо осуществлять постепенно.

Пациенты пожилого возраста более склонны к развитию артериальной гипотензии и нервно-мышечной реакции; за такими пациентами при лечении необходим тщательный надзор. Дозировка лекарственного средства в нижнем диапазоне достаточна для большинства пациентов пожилого возраста. Дозировка должна быть приспособлена к уровню индивидуальной реакции и соответствующим образом скорректирована. Увеличивать дозы таким пациентам необходимо постепенно. Применение лекарственного средства пожилым больным может вызвать проявления необратимой дискинезии.

Применение лекарственных средств фенотиазинового ряда у пациентов пожилого возраста с деменцией может повысить риск летального исхода.

Использование в экстремальных условиях может быть опасным, поскольку при применении фенотиазина возможно нарушение терморегуляции. Рекомендуется избегать воздействия прямых солнечных лучей.

Применение лекарственного средства должно длиться не дольше 12 недель, поскольку это может привести к развитию постоянной поздней дискинезии, которая может оказаться необратимой.

Если у пациента развиваются реакции гиперчувствительности (в т.ч. желтуха, патологические изменения крови), повторно фенотиазины назначать не следует.

При одновременном применении с седативными лекарственными средствами, анестетиками, транквилизаторами, алкоголем возможно развитие привыкания.

Не рекомендуется в период лечения лекарственным средством принимать алкоголь.

Действие фенотиазина на рвотный центр может маскировать симптомы передозировки другими лекарственными средствами.

Следует регулярно проверять зрение у пациентов, получающих долгосрочную терапию фенотиазином.

Следует с осторожностью назначать при острой инфекции или лейкопении.

После парентерального введения пациенты должны оставаться в положении лежа на спине в течение 30 минут под контролем артериального давления.

Важная информация о вспомогательных веществах.
Это лекарственное средство содержит менее 1 ммоль (23 мг)/дозу натрия, то есть практически свободное от натрия.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

В период лечения лекарственным средством необходимо воздерживаться от управления автотранспортом и от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими высокой скорости психомоторных реакций.

Применение в период беременности или кормления грудью

Лекарственное средство противопоказано в период беременности. При необходимости применения лекарственного средства, кормление грудью следует прекратить.

Способ применения и дозы

Применять внутримышечно. Начальная доза для взрослых составляет 1–2 мг. Повторное введение производить через 4–6 часов; при более частых инъекциях возможны явления кумуляции. Суточная доза, как правило, равна 6 мг, в исключительных случаях – 10 мг.
При депрессивно-галлюцинаторных и депрессивно-бредовых состояниях Трифтазин-Дарница применять совместно с антидепрессантами.
Лечение Трифтазином-Дарница должно быть строго индивидуализировано в зависимости от течения заболевания. Срок лечения не должен превышать 12 недель.

Дети

Не рекомендуется применять лекарственное средство для лечения детей ввиду ограниченного клинического опыта.

Передозировка

Передозировка проявляется дискинезией, дизартрией, сонливостью и ступором, экстрапирамидными нарушениями, непроизвольными сокращениями мышц, артериальной гипотензией или гипертензией, сердечными аритмиями, судорогами, изменениями на электрокардиограмме, лихорадкой, вегетативными расстройствами, сухостью во рту, кишечной непроходимостью. В тяжелых случаях возможна кома.

Лечение. Лечение является симптоматическим и поддерживающим. При угнетении дыхания проводить искусственную вентиляцию легких, кислородную терапию. Коррекция кислотно-щелочного равновесия, водно-электролитного баланса, форсированный диурез.

Побочные реакции

Со стороны органов зрения: парез аккомодации, ретинопатия, помутнение хрусталика и роговицы, нарушения зрительного восприятия, конъюнктивит.
Со стороны желудочно-кишечного тракта: сухость во рту, гиперсаливация, анорексия, булимия, тошнота, рвота, диарея, запор, гастралгия, парез кишечника, тризм, протрузия языка.
Со стороны печени и желчевыводящих путей: холестатическая желтуха, гепатотоксичность, гепатит.
Со стороны почек и мочевыводящей системы: снижение потенции, нарушение эякуляции, приапизм, задержка мочи, олигурия, нарушение мочеиспускания.
Со стороны эндокринной системы: гипо- или гипергликемия, глюкозурия, нарушение менструального цикла (дисменорея, аменорея), гинекомастия, увеличение массы тела, галакторея, боль в груди, нарушение либидо, гиперпролактинемия.
Со стороны нервной системы: головная боль, сонливость, головокружение, вялость, бессонница, акатизия, дистонические экстрапирамидные реакции (которые могут включать спазм шейных мышц, кривошею, экстензию мышц спины с возможным прогрессированием в опистотонус, карпопедальний спазм, тризм, трудности глотания, окулогирный криз, протрузию языка; эти симптомы исчезают в течение нескольких часов или через 24–48 часов после отмены лекарственного средства), псевдопаркинсонизм (маскообразное лицо, слюнотечение, движения «прокаты таблетки», синдром жесткости зубчатого колеса, шарканье обувью), поздняя дискинезия (симптомы могут быть необратимыми, характеризуются ритмичными непроизвольными движениями языка, рта, челюсти (например, протрузия языка, пыхтение щек, сморщивание рта, жевательные движения), поздней дистонией, непроизвольными движениями конечностей (движения конечностей могут быть единственными проявлениями

поздней дискинезии)), поздняя дисамнезия, злокачественный нейролептический синдром, явления психической индифферентности, запоздалая реакция на внешние раздражители, акинетико-ригидные явления, гиперкинезы, тремор, вегетативные нарушения, поздняя дискинезия лицевых мышц, дистония, нарушение терморегуляции, повышенная утомляемость, нарушение сознания, ригидность мышц, судороги.
Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, снижение артериального давления (ортостатическая гипотензия), нарушения ритма сердца, изменения электрокардиограммы (удлинение интервала QT, сглаживание зубца Т), приступы стенокардии, желудочковая аритмия по типу torsades de pointes, остановка сердца.
Со стороны крови и лимфатической системы: тромбоцитопения, агранулоцитоз, анемия (гемолитическая, апластическая), панцитопения, лейкопения, тромбоцитопеническая пурпура, эозинофилия.
Со стороны иммунной системы: аллергические реакции, включая сыпь, крапивницу, ангионевротический отек, анафилактический шок.
Со стороны кожи и подкожной клетчатки: фотодермия, покраснение кожи, депигментация кожи, эксфолиативный дерматит.
Со стороны опорно-двигательной системы и соединительной ткани: миастения.
Общие нарушения и реакции в месте введения: слабость, отеки.
Лабораторные показатели: ложно-положительные тесты на беременность, фенилкетонурия.
Проявления побочных реакций, свойственных фенотиазинам: гипотермия, ночные кошмары, депрессия, гиперхолестеринемия, гиперпирексия, отек мозга, генерализованные и парциальные судороги, удлинение действия на ЦНС опиатов, анальгетиков, антигистаминных, барбитуратов, алкоголя, атропина, тепла, фосфорорганических инсектицидов, заложенность носа, адинамическая кишечная непроходимость, атония кишечника, миоз, мидриаз, реактивация психотических процессов, кататоничнобразные состояния, нарушение функции печени, желтуха, билиарный стаз, иррегулярные менструации, зуд, экзема, астма, эпинефриновый эффект, увеличение аппетита, волчаночноподобный синдром, пигментация кожи, эпителиальная кератопатия, лентикулярные и корнеальные отложения, внезапный летальный исход, асфиксия, реакции в месте введения, включая боль и раздражение.

Сообщения о подозреваемых побочных реакциях.
Сообщения о подозреваемых побочных реакциях после регистрации

лекарственного средства является важной процедурой. Это позволяет продолжать мониторинг соотношения «польза/риск» для соответствующего лекарственного средства. Медицинским работникам необходимо сообщать о любых подозреваемых побочных реакциях через национальную систему сообщений.

Срок годности

4 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °C. Не замораживать.
Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 1 мл в ампуле; по 5 ампул в контурной ячейковой упаковке; по 2 контурные ячейковые упаковки в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ЧАО «Фармацевтическая фирма «Дарница».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 02093, г. Киев, ул. Бориспольская, 13.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.